

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 9 月 15 日 (15.09.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/085294 A1(51) 国際特許分類⁷: C08B 37/08, A61K 31/519, 47/48,
A61P 19/02 // C07D 475/10, C07K 5/00式会社 (CHUGAI SEIYAKU KABUSHIKI KAISHA)
[JP/JP]; 〒1158543 東京都北区浮間 5 丁目 5 番 1 号
Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/003739

(72) 発明者; および

(22) 国際出願日: 2005 年 3 月 4 日 (04.03.2005)

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 池谷 仁志 (IKEYA,
Hitoshi) [JP/JP]; 〒1948560 東京都町田市旭町 3 丁
目 5 番 1 号 電気化学工業株式会社 中央研究所内
Tokyo (JP). 守川 忠志 (MORIKAWA, Tadashi) [JP/JP];
〒1948560 東京都町田市旭町 3 丁目 5 番 1 号 電気
化学工業株式会社 中央研究所内 Tokyo (JP). 高橋 浩
一 (TAKAHASHI, Koichi) [JP/JP]; 〒1948560 東京都
町田市旭町 3 丁目 5 番 1 号 電気化学工業株式会
社 中央研究所内 Tokyo (JP). 田村 達也 (TAMURA,
Tatsuya) [JP/JP]; 〒4128513 静岡県御殿場市駒門 1 丁
目 1 3 5 番地 中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP). 岡町
晃 (OKAMACHI, Akira) [JP/JP]; 〒4101123 静岡県裾
野市伊豆島田 8 2 2-1-A 1 0 3 Shizuoka (JP). 石澤
武宣 (ISHIZAWA, Takenori) [JP/JP]; 〒4128513 静岡県

(25) 国際出願の言語: 日本語

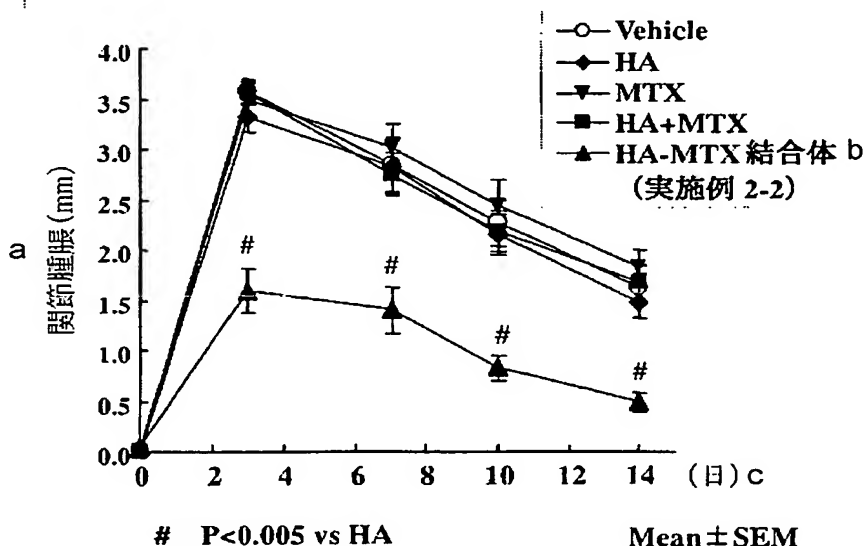
(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2004-062616 2004 年 3 月 5 日 (05.03.2004) JP
特願2004-167755 2004 年 6 月 4 日 (04.06.2004) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 電
気化学工業株式会社 (DENKI KAGAKU KOGYO
KABUSHIKI KAISHA) [JP/JP]; 〒1008455 東京都千
代田区有楽町 1 丁目 4 番 1 号 Tokyo (JP). 中外製薬株

[続葉有]

(54) Title: HYALURONIC ACID/METHOTREXATE COMPOUND

(54) 発明の名称: ヒアルロン酸-メトトレキサート結合体



a...JOINT SWELLING (mm)

b.... HA/MTX COMPOUND (EXAMPLE 2-2)

c.... DAYS

(57) Abstract: A hyaluronic acid/methotrexate compound useful as a therapeutic agent for joint diseases. The hyaluronic acid/methotrexate compound useful as a therapeutic agent for joint diseases comprises hyaluronic acid and methotrexate bonded to a carboxy group of the acid through a linker having a peptide chain comprising one to eight amino acids.

[続葉有]



WO 2005/085294 A1



御殿場市駒門 1 丁目 1 3 5 番地 中外製薬株式会社内
Shizuoka (JP). 佐藤 晴彦 (SATO, Haruhiko) [JP/JP]; 〒
4128513 静岡県御殿場市駒門 1 丁目 1 3 5 番地 中外
製薬株式会社内 Shizuoka (JP). 樋口 義信 (HIGUCHI,
Yoshinobu) [JP/JP]; 〒4128513 静岡県御殿場市駒門
1 丁目 1 3 5 番地 中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP).

(74) 代理人: 社本 一夫, 外 (SHAMOTO, ICHIO et al.); 〒
1000004 東京都千代田区大手町二丁目 2 番 1 号 新大
手町ビル 2 0 6 区 ユアサハラ法律特許事務所 Tokyo
(JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,

SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約: 本発明の課題は、関節疾患治療薬として有用な、ヒアルロン酸-メトトレキサート結合体を提供することである。この課題を解決する手段として、関節疾患治療薬として有用な、ヒアルロン酸のカルボキシル基に、1~8 値のアミノ酸からなるペプチド鎖を含有するリンカーを介してメトトレキサートが結合した、ヒアルロン酸-メトトレキサート結合体を見出した。